符 許 協 力 条 約

REC'D 1 0 MAR 2005

PCT

特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

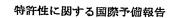
| | . • • | |
|---|--|---------------------------------------|
| 出願人又は代理人 の告類記号 Y0410-PCT | 後の手続きについては、様式PCT | /IPEA/416を参照すること。 |
| PC1/JP2004/004794 (| 際出願日 .月.年) 01.04.2004 | 優先日 (日.月.年) 02.04.2003 |
| 国際特許分類 (IPC) Int. Cl' CO | 7D401/0·6, A61K31/47 | 725, A61P9/10, 43/00 |
| 出願人 (氏名又は名称) 山之内製薬株式会社 | | |
| 1 アの初仕中以 アクラント | | |
| 1. この報告書は、PCT35条に基づきこ 法施行規則第57条(PCT36条)の規 |)国際予備審査機関で作成された国際 ≧に従い送付する。 | 祭予備審査報告である。 |
| 2. この国際予備審査報告は、この表紙を含 |)て全部で4 ペー | · ジからなる。 |
| 3. この報告には次の附属物件も添付されて a 附属 野類は全部で | 、 ス | |
| | | |
| 囲及び/又は図面の用紙(PC [*] | れた及び/又はこの国際予備審査機 規則70.16及び実施細則第607号 | と関が認めた訂正を含む明細書、請求の資 条照) |
| □ 第 Ⅰ 欄 4 . 及び補充欄に示した。 | うに 出版時にかけて国際出席。 | ーポッ 示の範囲を超えた補正を含むものとこの |
| | え用紙 | 小の配曲を超えた補正を含むものとこ |
| b 電子媒体は全部で 配列表に関する地本機にラーナル・・・ | | (電子媒体の種類 数を示す) |
| ブルを含む。(実施細則第802月 | 、コンピュータ読み取り可能な形式 参照) | (電子媒体の種類、数を示す)。 による配列表又は配列表に関連するテー |
| アの国際子供金本担告い | | |
| . この国際予備審査報告は、次の内容を含む | • | |
| 区 第 I 棚 国際予備審査報告の● 第 I 棚 優先権 | 遊 | |
| □ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は | 業上の利用可能性についての国際予 | 備審査報告の不作成 |
| 区 第IV欄 発明の単一性の欠如 区 第V欄 PCT35条(2)に規 | とする新規性、進歩性マロ産業 4の3 | 利用可能性についての見解、それを裏付 |
| けるための文献及び配 第VI欄 ある種の引用文献 | 明 | 切用可能性についての見解、それを裏付 |
| ■ 第VI欄 国際出願の不備 | | |
| □ 第V四棡 国際出願に対する意見 | | |
| 際予備審査の請求母を受理した日 | | |
| 06.07.2004 | 国際予備審査報告を作 23. | F成した日 ・ 0 2 . 2 0 0 5 |
| 外及びあて先 日本国際時度(LDRA (1-2) | 特許庁審査官(権限の | |
| 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 | 渡辺仁 | プめる職員) 4C 3229 |
| 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | | |
| | 電話番号 03-35 | 81-1101 内線 3452 |

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2004/004794

| 17 - | | | か、国際出願の言語を基礎とした。 |
|--|--|---|---|
| | の報告は、 | 語による翻訳文 担出される。 理想は | を基礎とした。 |
| Ų | | 提出された翻訳文の言語で 及び23.1(b)にいう国際調査 | た ス |
| | PCT規則12.4 | へ020.1kのにいり国际調査 にいう国際公開 | |
| | | スは55.3にいう国際予備審3 | ks . |
| | | | |
| 2. この# た差替え月 | 製管は下記の出願語 用紙は、この報告に | F類を基礎とした。(法第6 「おいて「出願時」とし、こ | 条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出さ の報告に添付していない。) |
| | 出願時の国際出願者 | | |
| | 月細審 | | |
| 第 | ¥ | ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| 第第 | | ページ*、 | 付けて国際文/##十世界 200 |
| <i>5</i> 5 | · | ページ*、 | 一 |
| . 🔲 請 | 水の範囲 | | |
| 第 | | 項、 | 出願時に提出されたもの |
| 第第 | | | PCT19条の規定に基べき補正されたよの |
| 第 | | | |
| _ | | 項*、 | |
| | | | • |
| 第第 | | ページ/図、 | 出願時に提出されたもの |
| 第 | | ページ/図⊭ | = · · · · · · · · · · · · · · · · · · · |
| 20 | | | 付けで国際予備審査機関が受理したもの |
| _ | | | |
| _ | 列表又は関連する | テープル・ | 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの |
| _ | 列表又は関連する | | |
| _ | 列表又は関連する | テープル・ | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関する | テーブル 浦充棡を参照すること。 | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関するね | テーブル 浦充棡を参照すること。 | |
| | 列表又は関連する: 配列表に関するね 正により、下記のも 明細書 | テーブル 浦充棡を参照すること。 | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関する 正により、下記の報 明細告 請求の範囲 | テーブル : 東充概を参照すること。 ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 正により、下記のも 明細書 間求の範囲 図面 配列表(具体的に | テーブル | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 正により、下記のも 明細書 間求の範囲 図面 配列表(具体的に | テーブル | |
| | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 正により、下記のも 明細書 間求の範囲 図面 配列表(具体的に | テーブル 甫充概を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 | |
| · □ 權ī | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 正により、下記の 明細書 間求の範囲 図面 配列表(具体的に 配列表に関連する | テーブル 南充棡を参照すること。 野類が削除された。 第 第 一 記載すること) テーブル(具体的に記載す | ページ |
| . □ 樹取 □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 正により、下記の 明細 時球の の面 配列表(具体的に 配列表に関連する の報告は、補充棚に | テーブル 東充綱を参照すること。 等類が削除された。 第 第 第 一 記載すること) テーブル(具体的に記載す | ページ 項 ページ/図 ること) |
| ・ 献 | 列表又は関連する。 配列表に関する。 配列表に関する。 可能ない、下記のも 明報の面 配列表に関連する。 の報告は、補充と の報告は、 を認める。 の報告は、 を認める。 の報告は、 を認める。 の報告は、 を認める。 | テーブル 東充綱を参照すること。 等類が削除された。 第 第 第 一 記載すること) テーブル(具体的に記載す | ページ 項 ページ/図 ること) |
| ・ 献 | 列表又は関連するを 配列表に関するを 配列表に関するを 明細なの 明神なの 配列表に関連する の の の の の の の の の の の の の の の の の の の | テーブル 浦充欄を参照すること。 夢類が削除された。 第 第 記載すること) テーブル (具体的に記載す 示したように、この報告に られるので、その補正がさる 第 第 | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) |
| ・ | 列表アンスは関連するを 対表により、 明確なのでである。 明本ののでは、 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のできる。 ので。 のできる。 のでで。 のできる。 のでで。 のできる。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 のでで。 | テーブル : 雨充欄を参照すること。 夢類が削除された。 第 第 記載すること) テーブル (具体的に記載すること) テーブル (具体的に記載すること) テーブル (具体的に記載すること) 示したように、この報告には ちれるので、その補正がされる。 第 第 | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) |
| . 配 権 | 列表アストラスト では、 の表では、 の表では、 のである。 では、 のである。 のでる。 のである。 のでる。 のである。 のである。 のである。 のである。 のである。 のである。 のである。 のである。 のでる。 のである。 のである。 のである。 のである。 のである。 ので。 ので。 のでる。 のでる。 のでる。 ので。 ので。 のでる。 のでる。 ので。 ので。 のでる。 ので。 ので。 ので。 のでる。 のでる。 のでる。 のでる。 ので。 ので。 のでる。 ので。 ので。 ので。 ので。 ので。 ので。 ので。 ので | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) |
| ・ 献 | 列表アンスを 対表では関連するを 対表では、 のででである。 では、は、 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででをできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででででをできる。 のでででででででででででででででででででででででででででででででででででで | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 ・テーブル(具体的に配載す ・テーブル(具体的に配載す ・テーズルの報告に られるので、その補正がされ 第 第 第 第 第 ・デーズルので、その報告に ・おきなので、その補正がされ ・ますること) | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) ページ 項 ページ/図 |
| ・ 献 | 列表アンスを 対表では関連するを 対表では、 のででである。 では、は、 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででをできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででででをできる。 のでででででででででででででででででででででででででででででででででででで | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 一 | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) ページ 項 ページ/図 |
| ・ 献 | 列表アンスを 対表では関連するを 対表では、 のででである。 では、は、 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででをできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででででをできる。 のでででででででででででででででででででででででででででででででででででで | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 ・テーブル(具体的に配載す ・テーブル(具体的に配載す ・テーズルの報告に られるので、その補正がされ 第 第 第 第 第 ・デーズルので、その報告に ・おきなので、その補正がされ ・ますること) | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) ページ 項 ページ/図 |
| ・ 献 | 列表アンスを 対表では関連するを 対表では、 のででである。 では、は、 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のでである。 のできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででをできる。 のでできる。 のでできる。 のでできる。 のででででをできる。 のでででででででででででででででででででででででででででででででででででで | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 ・テーブル(具体的に配載す ・テーブル(具体的に配載す ・テーズルの報告に られるので、その補正がされ 第 第 第 第 第 ・デーズルので、その報告に ・おきなので、その補正がされ ・ますること) | ページ 項 ページ/図 ること) 添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。 (PCT規則70.2(c)) ページ 項 ページ/図 |
| ・ 配 | 列表の記述 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配列列 告れ 神水面 表表 はた き の 田 具関 補の 田 人連 東 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 | テーブル 南充棡を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 ますること) ・テーブル(具体的に記載すること) テースので、その補正がされるので、その補正がされるので、その補正がされる。 第 第 第 第 | ページ 項 ページ/図 |
| ・ 配 | 列表の記述 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配配 明龍図配列列 告れ 神水面 表表 はた き の 田 具関 補の 田 人連 東 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 大 | テーブル 東充綱を参照すること。 野類が削除された。 第 第 第 第 ・テーブル(具体的に配載す ・テーブル(具体的に配載す ・テーズルの報告に られるので、その補正がされ 第 第 第 第 第 ・デーズルので、その報告に ・おきなので、その補正がされ ・ますること) | ページ 項 ページ/図 ページ/図 ページ/図 ページ/図 ページ/図 ページ/図 ページ/図 ページ |

| | IV欄 発明の単一性の欠如 | Į. | | | | | |
|----|--|----|--|--|--|--|--|
| | | 4 | | | | | |
| | 一 | | | | | | |
| | 団 清神のではない。 | | | | | | |
| | □ 追加手数料を納付した。 □ 対はママン・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・ | | | | | | |
| | 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。 | | | | | | |
| | 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。 | | | | | | |
| | X 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、簡求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。 | | | | | | |
| | 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。 | | | | | | |
| | 満足する。 | | | | | | |
| | 図 以下の理由により満足しない。 | | | | | | |
| | 請求の範囲 $1-3$ 及び $4-6$ の共通事項は、「 $(-)-N-\{2-[(R)-3-(6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル)ピペリジノ]エチル}-4-フルオロベンズアミドーリン酸塩」のみであるが、例えば、WO 00/75 前に公知の物質であるから、該化合物を先行技術に対して貢献する技術的特徴と認めることはできない$ | | | | | | |
| | してみると、両クレーム群は、特別な技術的特徴を共有するものとはいえないから、これらの一群の発明は単一の一般的発明概念を形成するように関連しているとは認められない。 | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | , | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| | | | | | | | |
| 4 | 1 the 48 | | | | | | |
| ~. | 4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。 | | | | | | |
| | X すべての部分 | | | | | | |
| | 請求の範囲 に関する部分 | | | | | | |
| | Cult & 100 1 | | | | | | |



国際出願番号 PCT/JP2004/004794

| 見解 | | | |
|----------------|--------------------|-------|--|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 .請求の範囲 | 1 — 6 | |
| 進歩性(IS) | 請求の範囲 請求の範囲 | 1-6 | |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 請求の範囲 | 1-6 | |

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1:WO 00/75133 A1 (山之内製薬株式会社) 2000.12.14

請求の範囲1-6に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1より進歩性を 有しない。

文献 1 には、(-)-N- $\{2-[(R)-3-(6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル) ピペリジノ] エチル<math>\}$ -4-フルオロベンズアミドーリン酸塩及び該化合物を有効成分とする医薬組成物が記載されている(請求項1-6、実施例4

該化合物を有効成分とする医染組成物が配取されている(開水場ユーロ、天地門49)。また、単離、精製は、結晶化等の通常の化学的操作を適用して行われる旨も記載されている(第8/1頁第3~4行)。 したがって、文献1に記載された発明において、結晶化の際に、溶媒、温度等の条件を適宜変更し、製剤化に有利な結晶を得ることは、当業者が容易に想到し得ることであり、当該事項による格別の効果も認められない。